

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 03-197467

(43)Date of publication of application : 28.08.1991

(51)Int.Cl.

C07D239/56
A01N 43/54

(21)Application number : 01-335187

(71)Applicant : NIPPON KAYAKU CO LTD

(22)Date of filing : 26.12.1989

(72)Inventor : INOUE YOSHIO
KOBAYASHI TADASHI
MASUI AKIO
ASAHIKAZUO

(54) PYRIMIDINONE DERIVATIVE, PREPARATION THEREOF AND INSECTICIDE-ACARICIDE CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

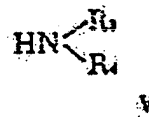
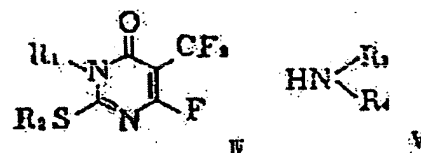
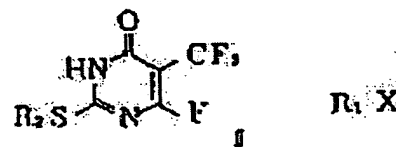
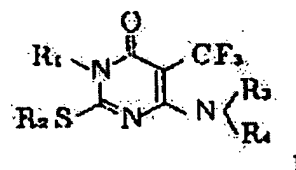
(57)Abstract:

NEW MATERIAL: A pyrimidine derivative of formula I (R₁ is H, 1-4C alkyl, alkenyl or alkynyl; R₂ is 1-3C alkyl; R₃ and R₄ are H, 1-6C alkyl which may be substituted, or substituted phenyl; or R₃ and R₄ are alkyls which may be combined with each other to form a ring).

EXAMPLE: 6-Diethylamino-2-methylthio-5-trifluoromethyl-4(3H)-pyrimidinone.

USE: Useful as an insecticidal acaricide and an antimicrobial agent in rice fields, upland fields, fruit gardens, forests and environmental hygienic fields.

PREPARATION: A compound of formula II is made to react with a compound of formula III (X is halogen) in the presence of a base in a non-reactive solvent and the prepared compound of formula IV is allowed to react with a compound of formula V in the presence of a base such as pyridine in an inert solvent to provide the compound of formula I.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

1000 12-12-12 12-12-12 12-12-12

Searching PAJ

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

THESE RESEARCH RESULTS (2010)

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A) 平3-197467

⑮ Int.Cl.⁵

C 07 D 239/56
A 01 N 43/54

識別記号

庁内整理番号

F 6529-4C
8930-4H

⑭ 公開 平成3年(1991)8月28日

審査請求 未請求 請求項の数 4 (全9頁)

⑮ 発明の名称 ビリミジノン誘導体その製法及びそれを有効成分とする殺虫・殺ダニ剤

⑯ 特 願 平1-335187

⑰ 出 願 平1(1989)12月26日

⑱ 発 明 者	井 上	義 雄	神奈川県大和市つきみ野1-8-17
⑱ 発 明 者	小 林	匡	埼玉県上尾市大字平方4279-1 ソレイユ203
⑱ 発 明 者	榎 井	昭 夫	埼玉県大宮市南中野1-14
⑱ 発 明 者	朝 比 奈	和 雄	埼玉県上尾市仲町2-13-4 ファーストハイム311
⑰ 出 願 人	日本化学株式会社		東京都千代田区富士見1丁目11番2号

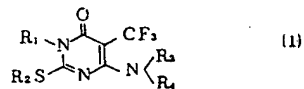
明 細 書

1. 発明の名称

ビリミジノン誘導体その製法及びそれを有効成分とする殺虫・殺ダニ剤

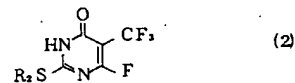
2. 特許請求の範囲

(1) 一般式



(式中、 R_1 は水素原子、炭素数1～4ケの低級アルキル基、アルケニル基、アルキニル基を表わし、 R_2 は炭素数1～3ケの低級アルキル基を表わし、 R_3, R_4 は水素原子もしくは炭素数1～6ケの枝分れしてもよい、もしくは R_3 と R_4 が互いに連結して環を形成してもよいアルキル基、もしくは置換フェニル基)で表わされるビリミジノン誘導体

(2) 一般式

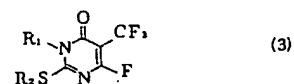


(式中、 R_2 は炭素数1～3ケの低級アルキル基を表わす。)

で表わされる化合物を



(式中、 R_1 は炭素数1～4ケの低級アルキル基、アルケニル基、アルキニル基を表わし、 X はハロゲン原子を表わす)と反応させ、得られた一般式



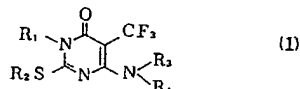
(ただし上記式(3)中、 R_1, R_2 は前記式(1)と同じものを表わす)

で表わされる化合物を一般式(4)



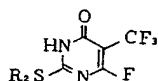
(ただし上記式(4)中、 R_3, R_4 は前記式(1)と同じものを表わす)

で表わされる化合物と反応させることを特徴とする一般式

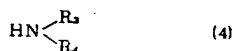


(式中、 $R_1 \sim R_4$ は前記と同じものを表わす)
で表わされる化合物の製法

(3) 一般式



(式中、 R_2 は前記と同じものを表わす)
で表わされる化合物と一般式



(式中、 R_3, R_4 は前記と同じものを表わす)
で表わされる化合物を反応させ一般式

- 3 -

(式中、 $R_1 \sim R_4$ は前記と同じものを表わす)
で表わされるピリミジン誘導体の1種又は2種以上を有効成分として含有することと特徴とする農園芸用殺虫、殺ダニ又は殺菌剤。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明による殺虫、殺ダニ、殺菌組成物は水田、畑、果樹園、森林および環境衛生場面における殺虫、殺ダニ剤もしくは殺菌剤として利用することができる。

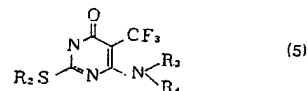
〔従来の技術〕

ある種のピリミジノン誘導体には殺虫、殺ダニ、殺菌活性があることはたとえば特開昭63-112566号公報、及び特開平1-190670号公報に記載されている。しかしながら5位にトリフルオロメチル基をかつ6位にアルキルアミノ基を有するピリミジノン誘導体は知られていない。

〔発明が解決しようとする課題〕

しかしながらこれらの化合物は殺虫、殺ダニ

- 5 -

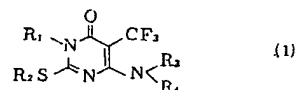


(式中、 R_2, R_3, R_4 は前記と同じものを表わす)

化合物を製造し、この化合物を式

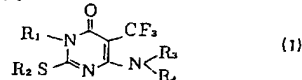


(式中、 R_1 は炭素数1~4ケの低級アルキル基、アルケニル基又はアルキニル基を表わし、 X はハロゲン原子を表わす)と反応させることを特徴とする一般式



(式中、 $R_1 \sim R_4$ は前記と同じものを表わす)
で表わされる化合物の製造法。

(4) 一般式

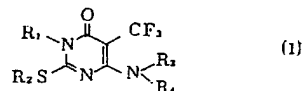


- 4 -

剤もしくは殺菌剤の有効成分として必ずしも充分なものとはいえない。

〔課題を解決するための手段〕

本発明者らは上記の状況にかんがみ、鋭意研究の結果、式

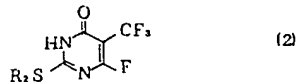


(ただし式中、 R_1 は水素原子、炭素数1~4ケの低級アルキル基、アルケニル基、アルキニル基を表わし、 R_2 は炭素数1~3ケの低級アルキル基を表わし、 R_3, R_4 は水素原子もしくは炭素数1~6ケの枝分れしてもよい、もしくは R_3 と R_4 が互いに連結して環を形成してもよいアルキル基、もしくは置換フェニル基)で表わされるピリミジノン誘導体は強い殺虫、殺ダニ活性もしくは殺菌活性を有することを見出し本発明を完成するに至った。

本発明の一般式(1)の化合物は以下の方法によって製造できる。すなわち特開昭63-216877

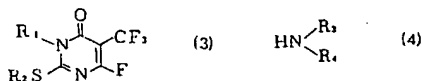
- 6 -

号公報に記載の方法によって出発原料である一般式



(式中、 R_1 は炭素数1～3ケの低級アルキル基を表わす。)

を用いて、適当な塩基(例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸水素ナトリウム、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム等)の存在下、反応に影響しない溶媒中で $\text{R}_1\text{---X}$ (2)(Xはハロゲン原子)と反応させて下記一般式(3)で表わされる化合物を製造し、さらに一般式(3)で表わされる



化合物を上記一般式(4)で示す化合物と適当な塩基(例えば、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム等)の存在下

- 7 -

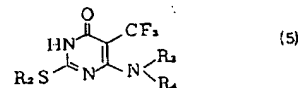
はトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素、メタノール、エタノール等のアルコール類、アセトン等のケトン類、ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル等のエーテル類を使用することができる。また、水も使用できることがある。これらの溶媒の混合溶媒や水との混合溶媒も使用することができる。温度としては -20°C から反応に使用する溶媒の沸点までの範囲をとることができる。原料のモル比は任意に設定できるが、等モルまたはそれに近い比率で反応を行うのが有利である。触媒として反応系に相間移動触媒(例えば、テトラアンモニウム塩等)を加えてもよい。

以下、本発明化合物の製造法を実施例をあげて具体的に説明する。本発明はこれらのみに限定されるわけではない。

本発明の一般式(1)の化合物を害虫防除剤として使用する場合、使用目的に応じてそのままか

反応に影響しない溶媒中で反応させて一般式(1)で示す化合物を製造することができる。一般式(4)で示す化合物を2当量以上用いた場合、塩基の存在は必ずしも必要ではない。

また一般式(2)で示す化合物を適当な塩基(例えば、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム等)の存在下、反応に影響しない溶媒中で一般式(4)で示す化合物と反応させて下記一般式(5)で示す化合物を製造し、さらにこの一般式(5)で示す化合物



と $\text{R}_1\text{---X}$ (2)(Xはハロゲン原子)を適当な塩基(例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、トリエチルアミン、ピリジン等)の存在下、反応に影響しない溶媒中で反応させて一般式(1)で示す化合物を製造することもできる。

本発明において反応に影響しない溶媒として

- 8 -

または効果を助長あるいは安定にするために農薬補助剤を混用して、農薬製造分野において一般に行なわれている方法により、粉剤、細粒剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、乳剤および溶液等の製造形態にして使用することができる。これらの種々の製剤は実際の使用に際しては、直接そのまま使用するか、または水で所望の濃度に希釈して使用することができる。

ここに言う農薬補助剤としては担体(希釈剤)およびその他の補助剤たとえば展着剤、乳化剤、湿展剤、分散剤、固着剤、崩壊剤等をあげることができる。液体担体としては、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、ブタノール、オクタノール、グリコールなどのアルコール類、アセトン等のケトン類、ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類、メチルナフタレン、シクロヘキサノン、動植物油、脂肪酸、脂肪酸エステルなどまた灯油、軽油等の石油分留物や水などがあげられる。

- 10 -

固体担体としてはクレー、カオリン、タルク、珪酸土、シリカ、炭酸カルシウム、モンモリロナイト、ベントナイト、長石、石英、アルミナ、鋳屑などがあげられる。

また乳化剤または分散剤としては通常界面活性剤が使用され、たとえば高級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルトリメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルベタインなどの陰イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、非イオン系界面活性剤、両性イオン系界面活性剤があげられる。

又、展着剤としてはポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンラウリルエーテルなどがあげられ、湿展剤としてはポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルジアルキルスルホサクシネートなどがあげられ、固着剤としてカルボキシメチルセルロース、ポリビニルアルコールなどがあげられ、崩壊剤としてはリグニンスルホン酸ナトリウム、ラウリ

-11-

g、好ましくは1.0~5.0 gが使用され、衛生防害虫用剤は通常1m²当り有効成分量で0.01~1.0 g、好ましくは0.02~5 gが使用される。たとえば粉剤は10アールあたり有効成分で0.1~5.0 g、粒剤は有効成分で0.2~10.0 g、また乳剤、水和剤は有効成分0.1~1.0 gの範囲である。しかしながら特別の場合にはこれらの範囲を越えることが、または下まわることが可能であり、また時には必要でさえある。

次に、本発明の害虫防除剤の適用できる害虫の代表例を挙げる。

(1) 鱗翅目 [Lepidoptera] :

たとえばキンモンホソガ (Phyllonorycter ringoniolla)、コナガ (Plutella xylostella)、ワタミガ (Promalactis inonisea)、コカクモンハマキ (Adoxophyes orana)、マメシンクタイガ (Leguminivora glycinivorella)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、アワノメイガ (Ostrinia furnacalis)、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、アワ

-13-

ル硫酸ナトリウムなどがあげられる。

いずれの製剤もそのまま単独で利用できるのみならず殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物生長調節剤、土壌改良剤あるいは殺線虫剤と混合してもよくさらに肥料や他の農薬と混合して使用することもできる。

さらに、たとえばビペロニルブトキサイド、サルホキサイド、サフロキサンのビレスロイド用共力剤として知られているものを加えることにより、その効力を数倍にすることもできる。

本発明組成物中における有効成分含有量は製剤形態、施用する方法その他の条件により異なる場合によっては有効成分化合物のみでもよいが通常は0.2~9.5% (重量) 好ましくは0.5~3.0% (重量) の範囲である。

本発明の組成物の使用量に剤形、施用する方法、時期、その他の条件によって変るが、農園芸用剤、森林防害虫用剤及び牧野防害虫用剤は通常10アール当り有効成分量で0.1~1.00

-12-

ヨトウ (Pseudaletia separata)、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、イネツトムシ (Parara guttata)、モンシロチョウ (Pieris rapae crucivora)。

(2) 鞘翅目 [Coleoptera] :

たとえばドウガネブイブイ (Anomala cuprea)、マメコガネ (Popillia japonica)、イネゾウムシ (Echinocnemus squameus)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、ヒメマルカツオブシムシ (Anthrenus verbasci)、コクヌスト (Tenebrio mauritanicus)、コクゾウムシ (Sitophilus zeamais)、ニジュウヤホシテントウ (Henosepilachna vigintioctopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、マツノマダラカミキリ (Monochamus alternatus)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)。

(3) 双翅目 [Diptera] :

たとえばネツタイエカ (Culex pipiens fatigans)、ネツタイシマカ (Aedes aegypti)、

-14-

ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、クネバエ (*Illymya platyura*)、イエバエ (*Muscadomestica vicina*)、ウリミバエ (*Dacus cucurbitae*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)。

(4) 直翅目 [Orthoptera] :

たとえばケラ (*Gryllotalpa africana*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)。

(5) 膜翅目 [Hymenoptera] :

たとえばカブラハバチ (*Athalia rosae japonensis*)、ルリチュウレンジハバチ (*Arge similis*)。

(6) 線虫目 [Tylenchida] :

たとえばダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、イネシストセンチュウ (*Heterodera oryzae*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、イネシンガレセ

ンチュウ (*Aphelenchoaies besseyi*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus lignicolus*)。

(7) 半翅目

たとえばツマグロヨコバイ (*Nephotettix oincticeps*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、ホンヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ナシグンバイ (*Blepharitis nashi*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanoensis*)。

(8) ダニ目 [Acarina] :

たとえばナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、リンゴハダニ

-16-

(*Panonychus ulmi*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、ミカンサビダニ (*Aculus pelekassi*)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、ナシサビダニ (*Eutetranychus pyri*)、シクラメンホコリダニ (*Stencotarsonemus pallidus*)、カキヒメハダニ (*Tenuipalpus zhizhikashvili*)、チャノヒメハダニ (*Brevipalpus obovatus*)、クロバーハダニ (*Bryobia praeliosa*)、ブドウサビダニ (*Calepitrimerus vitis*)、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ネダニ (*Rhizoglyphus echinopus*)。

〔発明の効果〕

本発明のピリミジン誘導体は後記実施例から明らかなように殺虫、殺ダニ効果が優れている。

〔実施例〕

以下本発明により説明する。

実施例 1. 6-フルオロ-2-メチルチオ-3-プロパルギル-5-トリフルオロメチル-4-(3H)-ピリミジノンの合成 (中間体の合成) :

6-フルオロ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4-(3H)-ピリミジノンを 1.0 g をアセトン 1.0 ml に溶解し、これに炭酸カリウム 1.2 g、プロパルギルプロミド 0.63 g を加え、12 時間加熱還流した。室温に戻したのち水を加え酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム上で乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (シリカゲル; 展開液 n-ヘキサン: 酢酸エチル = 5:1) により精製し目的とする 6-フルオロ-2-メチルチオ-3-プロパルギル-5-トリフルオロメチル-4-(3H)-ピリミジノンを 0.38 g を得た。

¹H-nmr データ (CDCl₃, TMS); δ 2.35 (t, J = 2.4 Hz, 1H), δ 2.69 (s, 3H), δ 4.86 (d, J = 2.4 Hz, 2H)

実施例 2. 6-ジエチルアミノ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4-(3H)-ピリミジノンの合成 (本発明化合物 No. 1) :

6-フルオロ-2-メチルチオ-5-トリフ

-18-

特開平 3-197467(6)

ルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 1.0 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、氷水浴下、ジエチルアミン 0.71 g を滴下した。室温に戻し終夜撹拌したのち、水を加え酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム上で乾燥し、減圧下溶媒を留去した。粗生成物を n-ヘキサンとジエチルエーテルの混合溶媒で洗浄し、ろ過した。乾燥後、目的とする 6-ジエチルアミノ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 0.92 g を得た。

融点 157-158℃。

実施例 3. 3-アリル-6-ジエチルアミノ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノンの合成(本発明化合物 No 43) :

6-ジエチルアミノ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 0.9 g をアセトン 10 ml に溶解し、これに炭酸カリウム 0.88 g、アリルブロミド 0.46 g を

-19-

加え、12時間加熱還流した。室温に戻したのち、水を加え、酢酸エチルで抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム上で乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー(シリカゲル; 展開液 n-ヘキサン: 酢酸エチル=3:1)により精製し、目的とする 3-アリル-6-ジエチルアミノ-2-メチルチオ-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 0.43 g を得た。

融点 65-66℃。

実施例 4. 6-ジ-n-ブチルアミノ-2-メチルチオ-3-プロパルギル-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノンの合成(本発明化合物 No 56) :

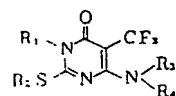
6-フルオロ-2-メチルチオ-3-プロパルギル-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 0.38 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、氷水浴下、ジ-n-ブチルアミン 0.54 g を滴下した。室温に戻し、6時間撹拌したのち、水を加え酢酸エチルで抽出した。

-20-

2.5%塩酸、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム上で乾燥し、減圧下溶媒を留去した。粗生成物を n-ヘキサンと酢酸エチルの 5:1 混合溶媒で洗浄し、ろ過した。乾燥後、目的とする 6-ジ-n-ブチルアミノ-2-メチルチオ-3-プロパルギル-5-トリフルオロメチル-4(3H)-ビリミジノン 0.41 g を得た。

融点: 135.5-137.0℃

表 1



化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	mp (°C)
No. 1	H	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	157-158
No. 2	H	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		140-141
No. 3	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	165-167
No. 4	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	128-130
No. 5	H	C ₂ H ₅	i-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	118-120
No. 6	H	C ₂ H ₅	i-C ₄ H ₉	i-C ₄ H ₉	169-171
No. 7	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₄ -		
No. 8	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₅ -		158-160
No. 9	H	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	176-178
No. 10	H	n-C ₃ H ₇	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₂ =CHCH ₂ -	111-113
No. 11	H	n-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₅ -		168-170
No. 12	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	99-102

- 22 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	mp (°C)
No. 13	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	76-79
No. 14	CH ₃	CH ₃	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	59-61
No. 15	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		98-99
No. 16	CH ₃	CH ₃	H	H	202-3
No. 17	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	198-199
No. 18	CH ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅	163-165
No. 19	CH ₃	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	90-91
No. 20	CH ₃	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇	120-122
No. 21	CH ₃	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉	63.5-66
No. 22	CH ₃	CH ₃	H	s-C ₄ H ₉	72-74
No. 23	CH ₃	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	99-102
No. 24	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	74-76
No. 25	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	72-74
No. 26	CH ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃	187-191
No. 27	CH ₃	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	150-152

- 23 -

表 1 (つづき)

化合物 (No.)	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	mp (°C)
No. 28	CH ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₂ H ₅	120-125
No. 29	CH ₃	C ₂ H ₅	H	i-C ₃ H ₇	79-83
No. 30	CH ₃	C ₂ H ₅	H	n-C ₄ H ₉	70-74
No. 31	CH ₃	C ₂ H ₅	H	s-C ₄ H ₉	48-50
No. 32	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₄ -		118-120
No. 33	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	CH ₃	121-125
No. 34	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	49-51
No. 35	C ₂ H ₅	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		106-107
No. 36	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	140-142
No. 37	C ₂ H ₅	CH ₃	H	C ₂ H ₅	119-120
No. 38	C ₂ H ₅	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇	118-120
No. 39	C ₂ H ₅	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉	100-102
No. 40	C ₂ H ₅	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	83-85
No. 41	C ₂ H ₅	CH ₃	H	s-C ₄ H ₉	71-74
No. 42	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	74-75

- 24 -

表 1 (つづき)

化合物 (No.)	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	mp (°C)
No. 43	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	65-66
No. 44	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	n-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	58-59
No. 45	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	48-49
No. 46	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		
No. 47	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		
No. 48	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	H	132-134
No. 49	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	C ₂ H ₅	110-111
No. 50	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	n-C ₃ H ₇	64-65
No. 51	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	55-57
No. 52	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	76-79
No. 53	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	n-C ₄ H ₉	64-66
No. 54	CH ₂ =CHCH ₂ -	CH ₃	H	s-C ₄ H ₉	47-49
No. 55	CH ₃	CH ₃	H	C ₆ H ₅	118-120
No. 56	CH≡CCH ₂	CH ₃	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	135.5-137

- 25 -

- 726 -

次に本発明の効果を試験例により具体的に説明する。

試験例 1. ナミハダニ殺卵試験

鉢植えインゲンマメの初生葉にナミハダニ成虫 10 頭を接種し、1 日後すべての成虫を取り除いた。本発明化合物および対照化合物の 20 % 乳剤（製剤例 5 で記載）または 50 % 水和剤（製剤例 2 で記載）を 500 ppm に希釈した水溶液に上記初生葉を 10 秒間浸漬し、風乾後 25 度の恒温室内に 9 日間静置し、卵の生死を調査した。死卵率はすべてアボット式を用いて補正して求めた。その結果、下記の化合物が死卵率 100 % であった。

Nb 13, 14, 18, 19~25, 27~33, 37, 38, 40~45, 49~52。

試験例 2. トビイロウンカに対する効果

3 ないし 4 葉期のイネ 5 ないし 6 本を 1 株とし、各供試薬剤の有効成分が 500 ppm になるように水で希釈した処理液に 15 秒間浸漬した。風乾後、直径 4.5 cm、高さ 15 cm のガラス製円

-26-

15 秒間浸漬した。風乾後、径 9 cm のプラスチック容器に入れ、コナガ 3 令幼虫 15 頭を容器中に放虫した。

容器には小穴を 5~6 ヶ所あけたふたをして、25 度の恒温室内に静置する。処理、放虫してから 10 日後に生死虫数を調査し、殺虫率を算出した。その結果、下記の化合物が殺虫率 100 % であった。

Nb 17, 20, 24。

特開平 3-197467(9)

筒に入れ、これにトビイロウンカ（加世田産）の雌成虫 10 頭を放虫し、金網のフタでおおいガラス温室内に静置した。処理 8 日後、生死虫数を調査し、殺虫率を算出した。その結果、下記の化合物が殺虫率 100 % であった。

Nb 14, 19, 33, 34~37, 40, 42, 44, 45。

試験例 3. ナカイエカに対する効果

プラスチックカップに井水 200 ml を入れ、ナカイエカ 3 令幼虫 10 頭を放虫する。各供試薬剤の有効成分が 5 ppm になるようにアセトンで希釈した薬液を 1 ml 加え、フタでおおい 25 度の恒温室内に静置した。処理後 7 日目に死虫数を測定し殺虫率を求めた。その結果、下記の化合物が殺虫率 100 % であった。

Nb 20, 23~26, 28, 31, 32, 55。

試験例 4. コナガに対する効果

キャベツ本葉 10 葉程度に生育したキャベツの中位葉を切りとり、各供試薬剤の有効成分が 500 ppm になるように水で希釈した処理液に

-27-

特許出願人 日本化薬株式会社

THIS PAGE BLANK (USPTO)